

ABSTRACT OF THE DISCLOSURE

A glycopeptide having at least one asparagine-linked oligosaccharide at a desired position of the peptide chain thereof,

5 which is obtained by:

(1) esterifying a hydroxyl group of a resin having the hydroxyl group and a carboxyl group of an amino acid having amino group nitrogen protected with a fat-soluble protective group,

(2) removing the fat-soluble protective group to form a free
10 amino group,

(3) amidating the free amino group and a carboxyl group of an amino acid having amino group nitrogen protected with a fat-soluble protective group,

(4) removing the fat-soluble protective group to form a free
15 amino group,

(5) repeating the steps (3) and (4) at least once,

(6) amidating the free amino group and a carboxyl group of the asparagine portion of an asparagine-linked oligosaccharide having amino group nitrogen protected with a fat-soluble protective group,

20 (7) removing the fat-soluble protective group to form a free amino group,

(8) amidating the free amino group and a carboxyl group of an amino acid having amino group nitrogen protected with a fat-soluble protective group,

25 (9) repeating the steps (7) and (8) at least once,

(10) removing the fat-soluble protective group to form a free amino group, and

(11) cutting off the resin with an acid;
glycopeptide obtained by transferring sialic acid or a
derivative thereof to the above glycopeptide using a sialic acid
transferase.

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 1 月 15 日 (15.01.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/005330 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07K 9/00, 1/04, 1/06, C08B 37/00 (74) 代理人: 田村 巖 (TAMURA, Iwao); 〒561-0872 大阪府豊中市 寺内 1 丁目 9 番 2 2 号 田村特許事務所 Osaka (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2003/008551 (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (22) 国際出願日: 2003 年 7 月 4 日 (04.07.2003) (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2002-196821 2002 年 7 月 5 日 (05.07.2002) JP
特願 2002-349166 2002 年 11 月 29 日 (29.11.2002) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚化学株式会社 (OTSUKA CHEMICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒540-0021 大阪府 大阪市 中央区大手通 3 丁目 2 番 2 7 号 Osaka (JP).
- (71) 出願人 および
(72) 発明者: 梶原 康宏 (KAJIHARA, Yasuhiro) [JP/JP]; 〒224-0014 神奈川県 横浜市 都筑区 牛久保東 2-4-2-205 Kanagawa (JP).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING SUGAR PEPTIDE HAVING ASPARAGINE SUGAR CHAIN AND THE SUGAR PEPTIDE

(54) 発明の名称: 糖鎖アスパラギンを有する糖ペプチドの製造法及び該糖ペプチド

(57) Abstract: A process for producing a peptide having at least one asparagine sugar chain, characterized by esterifying a hydroxy group of a hydroxylated resin with the carboxy group of an amino acid in which the amino nitrogen has been protected by a lipid-soluble protective group, eliminating the lipid-soluble protective group to form a free amino group, amidating the free amino group with the carboxy group of an amino acid in which the amino nitrogen has been protected by a lipid-soluble protective group or of the asparagine moiety of an asparagine sugar chain in which the amino nitrogen has been protected by a lipid-soluble protective group, eliminating the lipid-soluble protective group to form a free amino group, repeating the steps (3) and (4) one or more times, and cleaving the resin with an acid; and a sugar peptide capable of being obtained by the production process.

(57) 要約:

- (1) 水酸基を有する樹脂 (レジン) の水酸基と、脂溶性保護基でアミノ基窒素が保護されたアミノ酸のカルボキシル基をエステル化反応させ、
- (2) 上記脂溶性保護基を脱離して遊離アミノ基を形成させ、
- (3) この遊離アミノ基と、脂溶性保護基でアミノ基窒素が保護されたアミノ酸又は糖鎖アスパラギンのアスパラギン部分のカルボキシル基とアミド化反応させ、
- (4) 上記脂溶性保護基を脱離して遊離アミノ基を形成させ、
- (5) 上記 (3) 及び (4) の工程を 1 回以上繰り返し、
- (6) 酸で樹脂 (レジン) を切断することを特徴とする少なくとも 1 以上の糖鎖アスパラギンを有するペプチドの製造方法、及び上記製造方法により取得可能な糖ペプチド。